

(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報 (A)

FI

(11)特許出願公開番号

特開平5-306221

(43)公開日 平成5年(1993)11月19日

(51) Int.Cl.5

識別記号

庁内整理番号

技術表示箇所

A 6 1 K 31/19 9/08

8413-4C AGZ

U 7329-4C

47/26

Z 7433-4C

審査請求 未請求 請求項の数2(全 3 頁)

(21)出願番号

特願平4-132042

(71)出願人 591246997

堀井薬品工業株式会社

平成4年(1992) 4月24日 (22)出願日

大阪府大阪市中央区内淡路町1丁目2番6

(72)発明者 河上 幸男

兵庫県西宮市塩瀬町名塩4627-120

(74)代理人 弁理士 赤岡 迪夫

(54) 【発明の名称】 腸管洗浄液用組成物及び腸管洗浄液

(57)【要約】

【目的】 クエン酸マグネシウム等張水溶液液と同等の 効果及び飲み易さを有し、しかも患者の電解質パランス の変動を生じない腸管洗浄液の提供を目的とする。

900mLあたりクエン酸マグネシウム3 【構成】 2. 3乃至35. 7gを含有し、更に塩化ナトリウム、 水酸化カリウム及び糖類を浸透圧が最終的に290乃至 310mOsm/Lとなる濃度に含有してなる水溶液で あることを特徴とする腸管洗浄液及び、水に溶解させて 該水溶液を製するための腸管洗浄液用粉末組成物。





特開平5-306221

【請求項1】900mLあたりクエン酸マグネシウムを 【特許請求の範囲】 32. 3乃至35. 7g含有し、更に塩化ナトリウム、 水酸化カリウム及び糖類を浸透圧が最終的に290乃至 310mOsm/Lとなる濃度に含有してなる水溶液で あることを特徴とする腸管洗浄液。

1

【請求項2】 クエン酸マグネシウムを含有し、該クエン 酸マグネシウムの32.3乃至35.7gあたり塩化ナ トリウム4. 8乃至5. 4mmo1、水酸化カリウム 8. 5乃至9. 3mmol及び糖類10. 7乃至2. 1 gを更に含有することを特徴とする、水に溶解して浸透 圧290乃至310mOsm/Lの水溶液として使用す るための腸管洗浄液用組成物。

【発明の詳細な説明】

【産業上の利用分野】本発明は、腸管洗浄液及び、水に [0001] 溶かして該腸管洗浄液を調製するための腸管洗浄液用組 成物に関する。

【従来の技術】腸管の洗浄による清浄化は、注腸X線検 査や大腸内視鏡検査において診断の正確さを確保するた めにも、また、腸切除術等において術後の感染症を予防 するためにも、不可欠の前処置である。近年、大陽疾患 の増加により腸管洗浄は医療における実施頻度と重要性

をいよいよ増しつつある。 [0003] 腸管洗浄には、古くは洗腸を行う方法が一 般的であったが、洗浄液の十分な排出という面で難点を 有し、造影剤の希釈によって微細病変の診断を困難にす るという問題があった。その後、ブラウンによる洗腸を 行わない前処置法の報告 [Brown, G.R.: Univ. Michiga n M Bull 27: 225-230, 1961) 以降、経口的に摂取した 大量の水分によって腸管を洗浄する種々の方法が開発さ

【0004】プラウンによる方法は、検査前日に水分を れてきた。 大量に摂取させた後、腸管からの水分吸収を阻害する塩 類下剤を投与するとともに、接触性下剤によって腸管の 蠕動運動を亢進させて腸内容物を一気に洗い流すことを

【0005】しかしプラウンによる方法では右半結腸の 特徴とする。 清浄化が困難であることや、大量の水分摂取が心不全や 腎障害のある患者に与え得る悪影響への懸念から、その 後、生理食塩水をベースとした電解質水溶液の大量服用 法 [J. Hewitt, et al., Lancet, 2: 337(1973) や、マ ンニトール添加電解質溶液 (Minervini, S. et al., Gu t, 20: A452, 1979) が提案されたが、前者は相当量の 水分吸収を起こすため、後者はマンニトールの腸内細菌 による分解で生じた水素やメタンガス等による術中の腸 内爆発事故のため、一般に使用されていない。

[0006] その後、ポリエチレングリコールと電解質 を主成分とした経口腸管洗浄液(以下「PEG液」とい 50

う。)が開発され普及しつつある〔Davis, G. R. et a l., Gastroenterology, 78, 991-995, 1980). PEG 液による洗浄効果は高いものであるが、やはり大量(約 2 L以上) の洗浄液を服用するものであることから、広 く用いられるためには服用の容易なことが必要である。

【0007】しかし、PEG液は多量に服用するには味 覚上かなりの難点があり、服用困難や服用後の吐き気等 患者に苦痛を与えることから、該洗浄液を広く一般的に 使用するには問題がある。

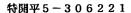
[0008] このため最近では、PEG液と同等又はそ れ以上の効果を有する關管洗浄液として、クエン酸マグ ネシウム等張液の服用が試みられている。クエン酸マグ ネシウムは、腸管からは殆ど吸収されず、体液と等張と なるよう水に溶解した液を1800至2700mLを経 口投与することにより、実質上、水分の体液側への吸収 や体液側からの脱水を伴うことなく、腸管内を短時間に 且つPEG液と同等又はそれ以上の優れた効果をもって 洗浄することができることが報告されている (基礎と臨 床、第24巻第14号第246 -365 頁(1990)〕。しかもク エン酸マグネシウム液は味覚の点でPEG液よりはるか に優れており、そのため服用が容易で服用後の吐き気も 生じにくい (同) ため、広く一般に用いる上で好ましい 洗浄液である。

【0009】なお本明細書において「クエン酸マグネシ ウム」とは、クエン酸一水素マグネシウム5水塩(Mg HC6 Hs O1 ・5H2 O) をいう。

【0010】 しかしながら、服用により必然的に引き起 こされる激しい下痢のためと考えられる体内の電解質パ ランスの変動が、クエン酸マグネシウム等張液の副作用 として見出されており、心、肺、腎等の機能障害等ため 電解質代謝に問題のある患者に使用するには潜在的危険 30 を伴う〔同〕。

[0011] クエン酸マグネシウム等張液による電解質 バランスの変動は、主としてカリウムイオン及び塩素イ オンの減少であり、これを防止する目的で、塩化カリウ ム錠を同時に服用することが試みられ一定の成果をあげ た。その一方、クエン酸マグネシウム等張液に塩化カリ ウムを直接添加すると「何ともいえないまずい味」とな るため、直接添加は実際上行い得ないことが判明してお り (同) 、腸管洗浄液と塩化カリウム錠との服用が別個 に行われている。 このような方法は煩雑であるのみなら ず、塩化カリウム錠服用の失念等に起因する副作用の発 生の可能性を潜在的にはらむものであり、何らかの改善 を必要とするものであった。

【発明が解決しようとする課題】本発明は、かかる状況 [0012] の下において、クエン酸マグネシウム等張液と同等の優 れた洗浄効果を有し、且つ患者の電解質バランスに与え る副作用を防止し、しかも味覚の点で服用し易い腸管洗 浄液及び該腸管洗浄液用組成物を提供することを目的と





する。

[0013]

【課題を解決するための手段】本発明者は、クエン酸マグネシウムをベースとする種々の組成物を検討した結果、クエン酸マグネシウムを主体としこれに塩化ナトリウム、水酸化カリウム、及び所望により白糖その他の甘味を有する糖類を一定範囲の比率に含有してなる体液と等張の水溶液が上記の目的に合致することを見出し、本発明を完成した。

3

【0015】更に本発明は、クエン酸マグネシウムを含有し、該クエン酸マグネシウム32.3乃至35.7g 20 あたり塩化ナトリウム4.8乃至5.4mmol、水酸化カリウム8.5乃至9.3mmol及び糖類10.7乃至2.1gを更に含有することを特徴とする、水に溶解して浸透圧290乃至310mOsm/Lの水溶液として使用するための腸管洗浄液用組成物である。

【0016】上記において糖類とは、甘味を有する糖類 例えば白糖、麦芽糖、ブドウ糖、果糖、転化糖等を含む。最も簡便には白糖が使用される。

【0017】 このような組成物の例えば50gを水に溶 加温する。冷後、精製水を加えて640Lとする。この 解して全量900mLとすることにより、目的とする浸 30 液にクエン酸21.0kgを加えて溶かし、これに水酸 透圧290乃至310mOsm/Lの範囲に入る腸管洗 化カリウム4.0kgと塩化ナトリウム2.4kgとを 浄液を容易に製造することができる。 予め水に溶解した液を加え、混合する。混合液を乾燥し

【0018】290乃至310mOsmol/Lの範囲の浸透圧は体液と実質的に等張であり、腸管から体液側への水分の吸収や体液側からの脱水のいずれも生じることなく腸管洗浄液として安全且つ有効に使用することができる浸透圧範囲である。その結果、本発明の腸管洗浄液は現行のクエン酸マグネシウム等張液と腸管洗浄効果において同等である。

【0019】また、本発明の腸管洗浄液によれば、現行 40 のクエン酸マグネシウム等張液に認められるような患者 の電解質パランスの変動を防止することができる。この ため、本発明の腸管洗浄液は心、肺、腎等の機能障害等

のため電解質代謝に問題のある患者においても安心して 使用することができ、従来のクエン酸マグネシウム等張 液のように、塩化カリウム錠等を別途に服用する必要が ない。

【0020】更に、患者の電解質パランスの変動防止のためにカリウムイオン等を含有しているにも拘わらず「何ともいえないまずい味」の発生が防止され、本発明の組成によれば現行のクエン酸マグネシウム等張液と同様に味覚上優れた、服用し易い腸管洗浄液が提供される。

【0021】本発明の陽管洗浄液用組成物の製造は、例えば次のようにして行うことができる。すなわち、先ず炭酸マグネシウムを水に分散させ、これにクエン酸を加えて溶解し、溶液に所定量の水酸化カリウムと塩化ナトリウムの水溶液を添加攪拌した後、溶液を乾燥して粉末化することにより得られる。糖類は例えば、こうして得られた粉末に添加することによって組成物に含ませることができる。

【0022】得られた混合粉末は、適宜の容器に包装して使用に供する。例えば、溶解に使用する一定の水量(例えば900mL)を表示した包装に体液と等張となるに必要な分量ずつ分包することによって、用時溶解して使用するに便利な製剤とすることができる。

【0023】次に典型的な一実施例を記すが、本発明は該実施例の詳細に限定されるものではない。

【実施例】精製水480Lに炭酸マグネシウム(日局 品) 86.5kgを分散させた後、クエン酸(日局品) 184.0 kgを徐々に加えてほぼ透明な液になるまで 加温する。冷後、精製水を加えて640Lとする。この 化カリウム4.0kgと塩化ナトリウム2.4kgとを 予め水に溶解した液を加え、混合する。混合液を乾燥し て粉末化し、乾燥品290kgを得る。得られた粉末に 白糖102.8kgを加え、混合機にて混合し、均一な 混合物とすることにより腸管洗浄液用組成物を得る。こ れを自動充填機により1包50g(900mL用)ずつ 充填する。本製剤1包50gを水に溶解し900mLと したものは浸透圧約300mOsm/Lであり、またカ リウムイオン、塩素イオン等の含有にも拘わらず、現行 のクエン酸マグネシウム等張液の味覚を損なうことな く、すなわちこれと同等の優れた味覚を保っており、腸 管洗浄液として不可避の大量服用に適したものであるこ とが確認された。